

# ФЕДЕРАЛЬНЫЙ ИНСТИТУТ ПРОМЫШЛЕННОЙ СОБСТВЕННОСТИ

Выбор баз данных
Параметры поиска
Формулировка запроса
Уточненный запрос
Найденные документы
Корзина
Сохраненные запросы
Статистика
Помощь
Предложения
Выход

У Вас осталось  
349 запросов  
(0 у.е.)

(11) Номер публикации 2001124348  
(13) Вид документа A  
(14) Дата публикации 2003.07.10  
(19) Страна публикации RU  
(21) Регистрационный номер заявки 2001124348/04  
(22) Дата подачи заявки 2000.01.31  
(31) Номер конвенционной заявки 60/118,029  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.02.01  
(33) Страна приоритета US  
(31) Номер конвенционной заявки 60/124,316  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.03.12  
(33) Страна приоритета US  
(31) Номер конвенционной заявки 60/133,374  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.05.10  
(33) Страна приоритета US  
(31) Номер конвенционной заявки 60/135,573  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.05.24  
(33) Страна приоритета US  
(31) Номер конвенционной заявки 09/333,387  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.06.15  
(33) Страна приоритета US  
(31) Номер конвенционной заявки 60/151,412  
(32) Дата подачи конвенционной заявки 1999.08.30  
(33) Страна приоритета US  
(43) Дата публикации заявки 2003.07.10  
7  
C07H19/00  
A61K31/70  
A61P29/00  
Название Композиция для борьбы с воспалительной реакцией  
(71) Имя заявителя ЮНИВЕРСИТИ ОФ ВИРДЖИНИЯ  
ПЭЙТЕНТ ФАУНДЕЙШН (US)  
(72) Имя изобретателя ЛИНДЕН Джозел М. (US)  
(72) Имя изобретателя САЛЛИВАН Гейл В. (US)  
(72) Имя изобретателя СЭРЕМБОК Ян Дж. (US)  
(72) Имя изобретателя МАКДОНАЛЬД Тимоти (US)  
(72) Имя изобретателя ОКЬЮЗА Марк (US)  
(72) Имя изобретателя КРОН Ирвинг Л. (US)  
(72) Имя изобретателя ШЕЛД В. Майкл (US)

BEST AVAILABLE COPY

## Российские патенты: Текст документа

Page 2 of 2



(74) Патентный поверенный

Егорова Галина Борисовна

(85) Дата соответствия ст.22/39 PCT

2001.09.03

(86) Номер и дата международной или региональной заявки

US 00/02324 (31.01.2000)

(87) Номер и дата международной или региональной публикации

WO 00/44763 (03.08.2000)

(98) Адрес для переписки

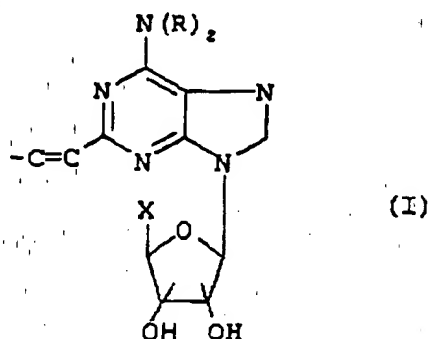
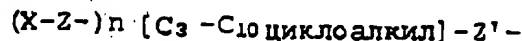
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25,  
стр.3, ООО "Юридическая фирма  
Городисский и Партнеры", пат.пов. Г.Б.  
Егоровой

**ФЕДЕРАЛЬНЫЙ ИНСТИТУТ ПРОМЫШЛЕННОЙ  
СОБСТВЕННОСТИ**

## №2001124348. Реферат

Выбор баз данных
Параметры поиска
Формулировка запроса
Уточненный запрос
Найденные документы
Корзина
Сохраненные запросы
Статистика
<b>ДОКУМЕНТ</b>
Помощь
Предложения
Выход

### 1. Соединение формулы I



где (a) каждый из R независимо представляет водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил, фенил или фенил (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) алкил;

(v)  $\wedge$  представляет  $-\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ,  $-\text{OC(O)R}^2$ ,  $-\text{CH}_2\text{OC(O)R}^2$  или  $\text{C(O)NR}^3\text{R}^4$ .

(с) каждый из  $R^2$ ,  $R^3$  и  $R^4$  каждый независимо представляет H,  $C_{1-6}$ -алкил;  $C_{1-6}$ -алкил, замещенный одним-тремя  $C_{1-6}$ -алкокси,  $C_3-C_7$  циклоалкилами,  $C_{1-6}$ -алкилтио, галогенами, гидрокси, amino, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) amino, ди( $C_{1-6}$ -алкил) amino или  $C_{6-10}$  арилами, где арил может быть замещен одним-тремя галогенами,  $C_{1-6}$ -алкилами, гидрокси, amino, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) amino или ди( $C_{1-6}$ -алкил) amino;  $C_{6-10}$ -арил; либо  $C_{6-10}$ -арил, замещенный одним-тремя галогенами, гидрокси, amino, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) amino, ди( $C_{1-6}$ -алкил) amino или  $C_{1-6}$ -алкилами;

(d) Z и Z' независимо представляют (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) алкил, необязательно прерванный одним-трем S или непероксидным O, либо отсутствуют,

а п равно 1-3,

или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п.1, в котором 5'-X представляет  $-\text{CH}_2\text{OH}$  или  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ .

3. Соединение по п.2, в котором 5'-X представляет  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$ .

4. Соединение по п.3, в котором  $\text{R}^3$  представляет H, а  $\text{R}^4$  представляет  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$  алкил.

5. Соединение по п.1, в котором каждый из R представляет H или  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$  алкил.

6. Соединение по п.1, в котором  $\text{Z}'$  представляет  $-\text{CH}_2-$  или  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ .

7. Соединение по п.6, в котором Z представляет  $-\text{CH}_2-$  или  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ .

8. Соединение по п.1, в котором  $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  циклоалкил представляет циклогексил или цикlopентил.

9. Соединение по п.8, в котором X представляет  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -алкоксикарбонил,  $\text{C}(\text{O})\text{NR}^3\text{R}^4$  или ацетоксиметил.

10. Соединение по п.8, в котором X-Z представляет  $\text{HO}_2\text{C}-\text{Z}$ .

11. Соединение по п.8, в котором X-Z и  $\text{Z}'$  представляют трансконфигурацию относительно  $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  циклоалкила.

12. Соединение по п.1, в котором R представляет H, 5'-X представляет этиламинокарбонил, а  $(\text{X}-\text{Z})\text{n}[(\text{C}_3-\text{C}_{10})\text{циклоалкил}]-\text{Z}'$ - $\text{C}=\text{C}$ - представляет 2-(4-метоксикарбонилциклогексилметил)этинил или 2-(4-карбоксициклогексилметил)этинил.

13. Соединение по п.1, в котором R представляет H, 5'-X представляет этиламинокарбонил, а (X-Z)-n[(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)циклоалкил]-Z'-C=C- представляет 2-(4-ацетоксиметилциклогексилметил) этинил.
14. Соединение по п.1, представляющее собой [4-(3-{9-(2R, 3R, 4S, 5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил}проп-2-инил)циклогексил] метилацетат или его фармацевтически приемлемую соль.
15. Соединение по п.1, представляющее собой [(2R,3R,4S,5S)-5-(6-амино-2-{3-[4-(оксиметил)циклогексил]-проп-1-инил}пурин-9-ил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-N-этилкарбоксамида или его фармацевтически приемлемую соль.
16. Соединение по п.1, представляющее собой метил 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил})проп-1-инил)цикло-гексанкарбоксилат или его фармацевтически приемлемую соль.
17. Соединение по п.1, представляющее собой 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил})проп-1-инил)циклогексан-карбоновая кислота или его фармацевтически приемлемую соль.
18. Соединение по пп.1-17 для применения в лечении.
19. Соединение по п.18, в котором лечение представляет собой подавление воспалительной реакции.
20. Соединение по п.18, в котором 5'-X представляет CH<sub>2</sub>OH или C(O)NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>.
21. Соединение по п.18, в котором 5'-X представляет C(O)NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>.

43. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана

ударом, травматическим повреждением головного или спинного

.../fips.dll?key=FLRZXOJFVQRN&ty=8&docnm=1&doc=2001124348&cl=2&rm=78694 12.08.04

33. Соединение по п.18, представляющее собой [(2R,3R,4S,5S)-5-(6-амино-2-{3-[4-гидроксиметил]циклогексил}проп-1-инил)пурин-9-ил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-N-этил-карбоксамид.

34. Соединение по п.18, представляющее собой метил 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил})проп-1-инил)циклогексанкарбоксилат.

35. Соединение по п.18, представляющее собой 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил})проп-1-инил)циклогексанкарбоновую кислоту.

36. Соединение по п.18, в котором лечение дополнительно включает применение ингибитора фосфодиэстеразы, тип IV.

37. Соединение по п.36, в котором ингибитором является ролипрам.

38. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ишемией.

39. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция связана атеросклерозом.

40. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана аутоиммунным заболеванием.

41. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ишемическим/реперфузионным повреждением.

42. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция возникает в сердце, почке или легком.

43. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана

22. Соединение по п.21, в котором  $R^3$  представляет H, а  $R^4$  представляет  $(C_1-C_4)$  алкил.
23. Соединение по п.18, в котором каждый из R представляет H или  $(C_1-C_4)$  алкил.
24. Соединение по п.18, в котором  $Z'$  представляет  $-CH_2-$  или  $-CH_2-CH_2-$ .
25. Соединение по п.18, в котором Z представляет  $-CH_2-$  или  $-CH_2-CH_2-$ .
26. Соединение по п.18, в котором  $C_3-C_{10}$  циклоалкил включает циклогексил или цикlopентил.
27. Соединение по п.26, в котором X представляет  $(C_1-C_4)$  - алкоксикарбонил или ацетоксиметил.
28. Соединение по п.26, в котором X-Z представляет  $HO_2C-Z-$ .
29. Соединение по п.26, в котором X-Z и  $Z'$  представляют трансконфигурацию относительно  $C_3-C_{10}$  циклоалкила.
30. Соединение по п.18, в котором R представляет H, X представляет этиламинокарбонил, а  $(X-Z)_n[(C_3-C_{10})\text{-циклоалкил}]-Z'-C\equiv C-$  представляет 2-(4-метоксикарбонилциклогексилметил)этинил или 2-(4-карбоксициклогексилметил)этинил.
31. Соединение по п.18, в котором R представляет H, X представляет этиламинокарбонил, а  $(X-Z)_n[(C_3-C_{10})\text{-циклоалкил}]-Z'-C\equiv C-$  представляет 2-(4-ацетоксиметилциклогексилметил)этинил.
32. Соединение по п.18, представляющее собой [4-(3-{9-(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил}-6-аминопурин-2-ил)проп-1-инил]циклогексил]метилацетат.



мозга.

44. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана пересадкой органа, ткани или клетки.

45. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана инфекцией.

46. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция связана с заболеванием кожи.

47. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ангиопластикой, введением стента, шунта или имплантацией.

48. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана аллергическим заболеванием.

49. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана изнуряющей болезнью.

50. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана иммуноподавляющей терапией.

51. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана патологическим состоянием или симптомом у млекопитающего, причиной которого является активность  $A_{2A}$ -рецепторов аденозина, и желателен агонизм такой активности.

52. Применение соединения по пп.1-17 в качестве лекарственного препарата для лечения воспаления.

53. Применение по п.52, в котором лекарственный препарат включает ингибитор фосфодиэстеразы, тип IV.

54. Применение по п.53, в котором ингибитором фосфодиэстеразы

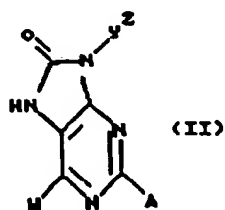
является ролипрам.

55. Применение по п.53, в котором лекарственный препарат включает жидкий носитель.

56. Применение по п.53, в котором лекарственный препарат адаптирован для парентерального введения.



Российские патенты: Текст документа



где W представляет собой атом водорода, низшую алкильную группу, атом галогена, низшую алкоксигруппу, моно- или ди-низшую алкиламиногруппу, или замещенную или незамещенную фенильную группу, Y<sup>2</sup> представляет собой атом водорода, низшую алкильную группу, циклоалкильную группу, циклоалкил-низшую группу, низшую алкенильную группу или замещенную или незамещенную фенил-низшую алкильную группу, и A представляет собой замещенную или незамещенную фенильную группу, или замещенную или незамещенную гетероарильную группу.

Библиография

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☒ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**